

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】令和 2 年 5 月 7 日 (2020.5.7)

【公表番号】特表 2019-515026 (P2019-515026A)

【公表日】令和 1 年 6 月 6 日 (2019.6.6)

【年通号数】公開・登録公報 2019-021

【出願番号】特願 2019-503398 (P2019-503398)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

C 0 7 D 209/14 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 C 69/757 (2006.01)

C 0 7 C 69/732 (2006.01)

C 0 7 C 69/738 (2006.01)

C 0 7 F 7/18 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 471/04 1 0 2

A 6 1 K 31/437

C 0 7 D 209/14 C S P

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 C 69/757 Z

C 0 7 C 69/732 Z

C 0 7 C 69/738 Z

C 0 7 F 7/18 A

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 3 月 30 日 (2020.3.30)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

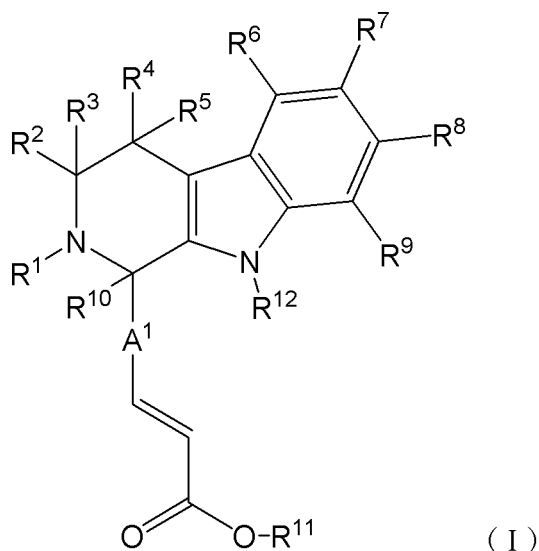
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物又はその薬学的に許容される塩であって、構造：

【化 1】



を有し、

A¹ が、任意に置換されたアリールであり、

R¹ が、任意に置換されたシクロアルキルであり、

R² 及び R³ がそれぞれ独立して、水素、ハロゲン、任意に置換された C₁ ~ 6 アルキル、及び任意に置換された C₁ ~ 6 ハロアルキルからなる群から選択されるか、又は R² 及び R³ が、R² 及び R³ が付着する炭素と一緒に、任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたシクロアルケニル、若しくは任意に置換されたヘテロシクリルを形成し、

R⁴ 及び R⁵ がそれぞれ独立して、水素、ハロゲン、任意に置換された C₁ ~ 6 アルキル、及び任意に置換された C₁ ~ 6 ハロアルキルからなる群から選択されるか、又は R⁴ 及び R⁵ が、R⁴ 及び R⁵ が付着する炭素と一緒に、任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたシクロアルケニル、若しくは任意に置換されたヘテロシクリルを形成し、

R⁶、R⁷、R⁸、及び R⁹ がそれぞれ独立して、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、任意に置換されたアルキル、任意に置換されたアルコキシ、任意に置換されたハロアルキル、任意に置換されたモノ置換アミン、及び任意に置換されたジ置換アミンからなる群から選択され、

R¹⁰ が、水素、ハロゲン、任意に置換されたアルキル、又は任意に置換されたシクロアルキルであり、

R¹¹ が、水素又は任意に置換された C₁ ~ 6 アルキルであり、

R¹² が、水素、又は C₁ ~ 3 アルキルである、化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

R¹¹ が、水素である、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

A¹ が、任意に置換されたフェニルである、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

A¹ が、置換フェニルである、請求項 3 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

A¹ が、3, 5 - ジフルオロフェニルである、請求項 4 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 6】

A¹ が、非置換フェニルである、請求項 3 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 7】

R¹ が、非置換シクロブチル、非置換ジフルオロシクロブチル、非置換シクロペンチル、及び非置換ビスシクロペンチルからなる群から選択される任意に置換されたシクロアルキルである、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

R¹ が、置換シクロアルキルである、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

R¹ が、非置換ビスシクロペンチルである、請求項 7 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 10】

R¹ が、非置換ビスシクロ[1.1.1]ペンチルである、請求項 9 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 11】

R² が、水素、メチル、フルオロメチル、及びジフルオロメチルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 12】

R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、及び R¹⁰ の各々のうちのいずれか 1 つ以上が、水素である、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 13】

R⁶ が、ヒドロキシである、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 14】

R⁷ が、ハロゲン、ヒドロキシ、及び非置換アルコキシからなる群から選択される、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 15】

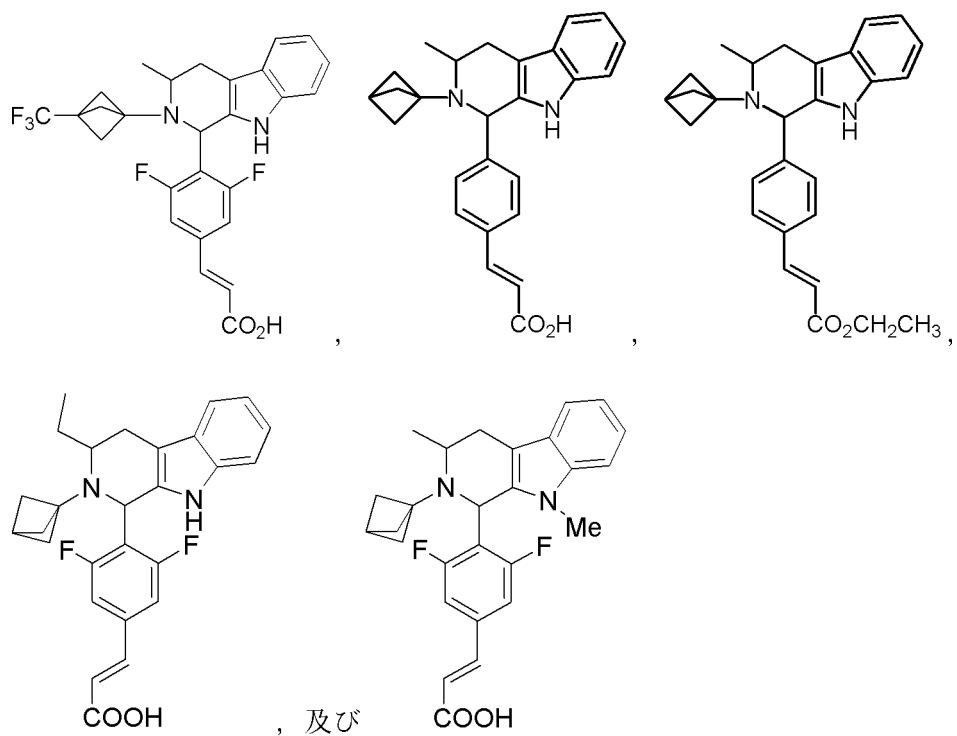
R⁷ が、フルオロ又はメトキシである、請求項 14 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 16】

R⁸ が、ヒドロキシである、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 17】

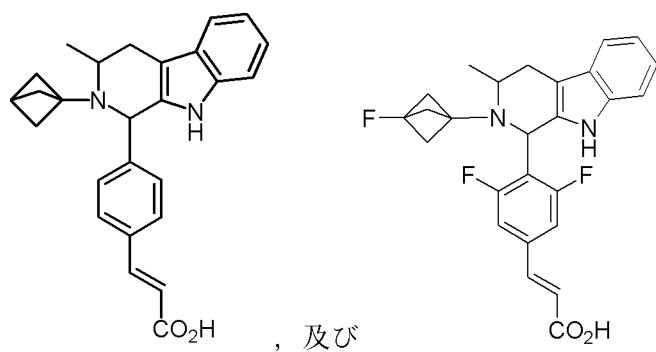
【化 2】



からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又は上記のうちのいずれかの薬学的に許容される塩。

【請求項 18】

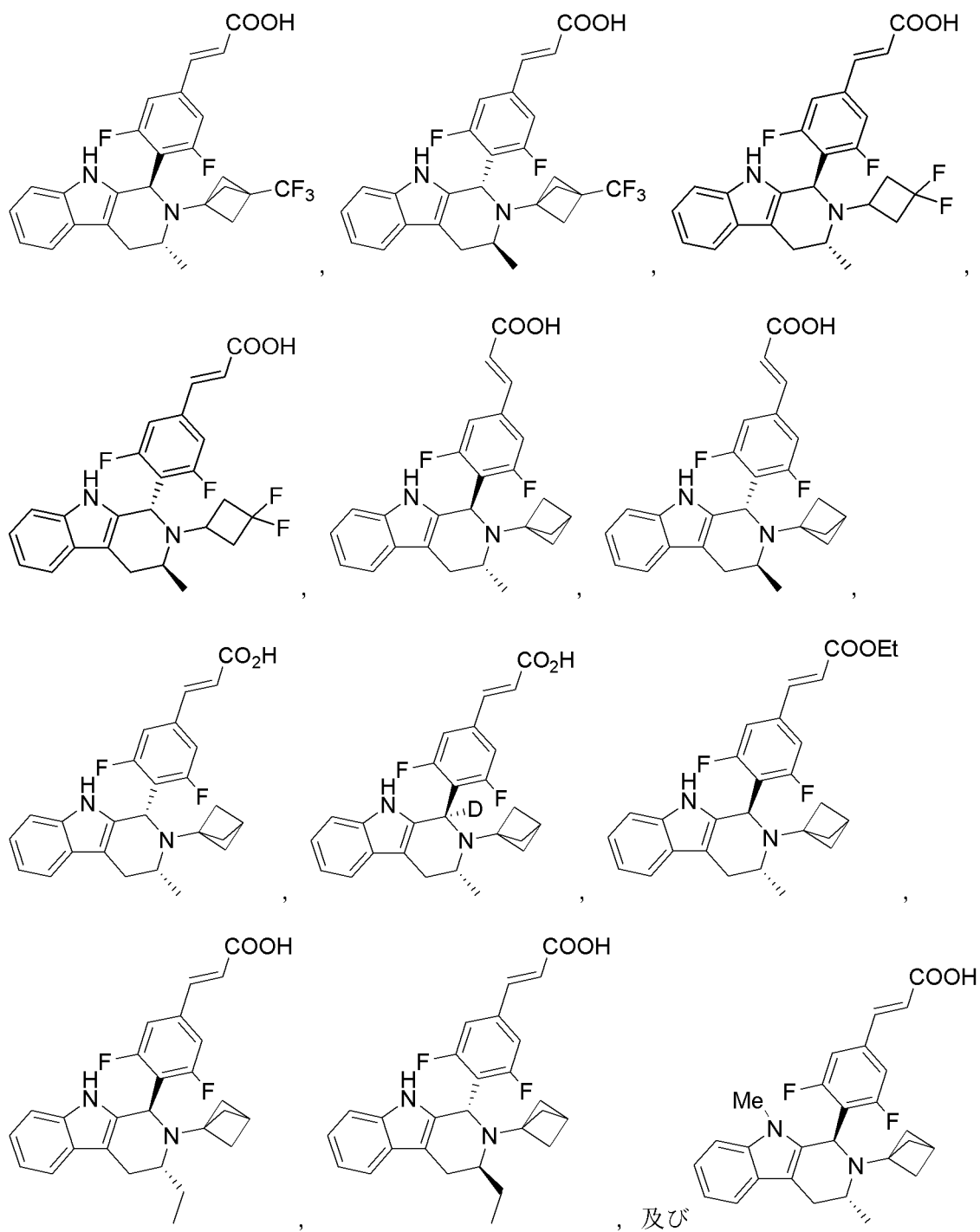
【化 3】



からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又は上記のうちのいずれかの薬学的に許容される塩。

【請求項 19】

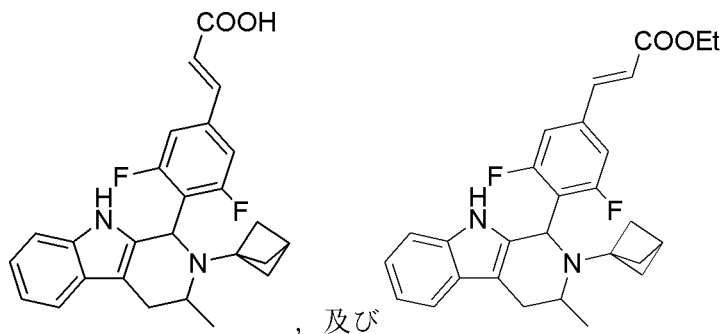
【化 4】



からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又は上記のうちのいずれかの薬学的に許容される塩。

【請求項 20】

【化 5】

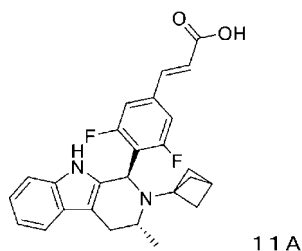


からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又は上記のうちのいずれかの薬学的に許容される塩。

【請求項 2 1】

式 1 1 A :

【化 6】



である請求項 1 に記載の化合物、又は薬学的に許容される塩。

【請求項 2 2】

有効量の請求項 1 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体、希釈剤、賦形剤、又はこれらの組み合わせとを含む、薬学的組成物。

【請求項 2 3】

細胞の成長を阻害する方法であって、細胞の成長特性を媒介するエストロゲン受容体 α を有する前記細胞を同定することと、前記細胞を、有効量の請求項 1 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の化合物若しくはその薬学的に許容される塩、又は請求項 2 2 に記載の薬学的組成物と接触させることと、を含む、方法。

【請求項 2 4】

エストロゲン受容体 α 依存性及び / 又はエストロゲン受容体 α 媒介性である癌の治療のための請求項 2 2 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 5】

前記癌が、乳癌及び婦人科癌からなる群から選択される、請求項 2 4 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 6】

前記癌が、乳癌、子宮内膜癌、卵巣癌、及び子宮頸癌からなる群から選択される、請求項 2 4 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 7】

前記癌が、乳癌である、請求項 2 4 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 8】

前記癌の治療が、静脈内投与を含む、請求項 2 4 ~ 2 7 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 9】

前記癌の治療が、経口投与を含む、請求項 2 4 ~ 2 7 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 3 0】

前記癌の治療が、筋肉内投与を含む、請求項 2 4 ~ 2 7 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 3 1】

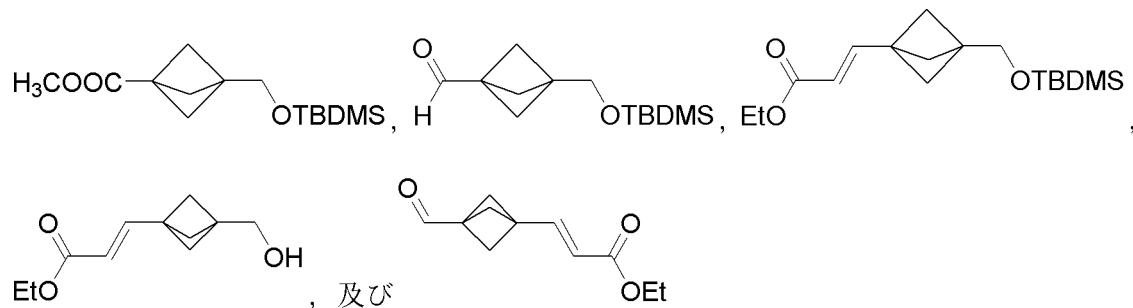
前記癌の治療が、皮下投与を含む、請求項 2 4 ~ 2 7 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 3 2】

前記癌の治療が、局所投与を含む、請求項 2 4 ~ 2 7 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 3 3】

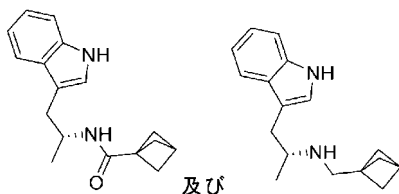
【化 7】



からなる群から選択される化合物。

【請求項 3 4】

【化 8】

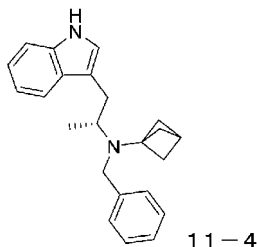


からなる群から選択される化合物。

【請求項 3 5】

以下の式 1 1 - 4 の化合物。

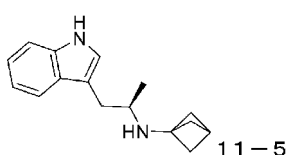
【化 9】



【請求項 3 6】

以下の式 1 1 - 5 の化合物。

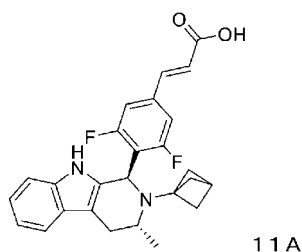
【化 1 0】



【請求項 3 7】

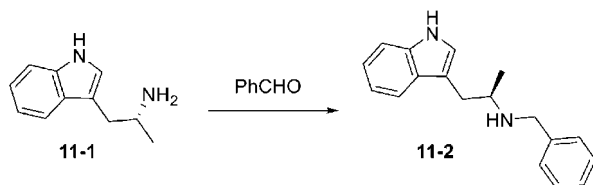
式 1 1 A の化合物を作製する方法であって、

【化 1 1】



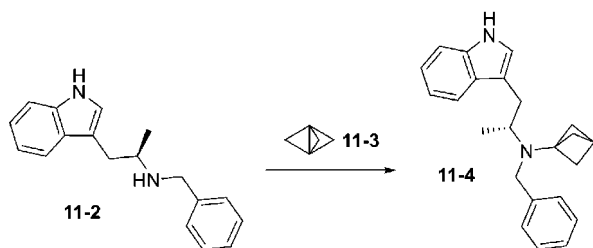
式 1 1 - 1 の化合物をベンズアルデヒドと反応させて、式 1 1 - 2 の化合物を形成することと、

【化 1 2】



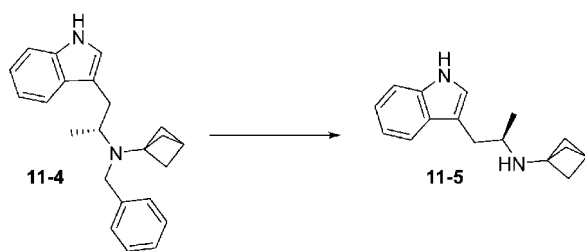
前記式 1 1 - 2 の化合物を式 1 1 - 3 のトリシクロ[1.1.1.0^{1,3}]ペンタンと反応させて、式 1 1 - 4 の化合物を形成することと、

【化 1 3】



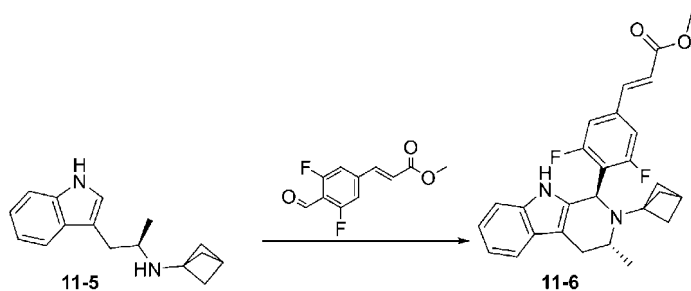
前記式 1 1 - 4 の化合物を水素化して、式 1 1 - 5 の化合物を形成することと、

【化 1 4】



前記式 1 1 - 5 の化合物を (E) - メチル - 3 - (3, 5 - ジフルオロ - 4 - ホルミルフェニル) アクリレートと反応させて、式 1 1 - 6 の化合物を形成することと、

【化 1 5】



前記式 1 1 - 6 の化合物を加水分解して、前記式 1 1 A の化合物を形成することと、を含む、方法。